

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003年1月9日 (09.01.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/002554 A1

(51) 国際特許分類: C07D 401/14, A61K 31/496,
A61P 9/10, 11/06, 29/00, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/06491

(22) 国際出願日: 2002年6月27日 (27.06.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
09/893,681 2001年6月29日 (29.06.2001) US

(71) 出願人: 興和株式会社 (KOWA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
460-8625 愛知県名古屋市中区錦三丁目6番29号
Aichi (JP).

(72) 発明者: 児玉 龍彦 (KODAMA, Tatsuhiko); 〒154-0002
東京都世田谷区下馬4丁目16-5 Tokyo (JP). 田
村 正宏 (TAMURA, Masahiro); 〒189-0022 東京都東
村山市野口町2丁目17-4 3-1 0 4 Tokyo (JP). 小
田 敏明 (ODA, Toshiaki); 〒189-0014 東京都東村山市
本町2丁目16-1 2-3 0 2 Tokyo (JP). 山崎 行由
(YAMAZAKI, Yukiyo); 〒189-0014 東京都東村山
市本町1丁目12-1 3-4 0 6 Tokyo (JP). 西川 雅
大 (NISHIKAWA, Masahiro); 〒189-0022 東京都東村
山市野口町2丁目17-4 3-4 0 5 Tokyo (JP). 土肥
武 (DOI, Takeshi); 〒189-0022 東京都東村山市野口

町2丁目17-4 3-3 6 Tokyo (JP). 京谷 善徳 (KY-
OTANI, Yoshinori); 〒207-0021 東京都東大和市立野
3丁目1293-1 0-2-1 1 2 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE
PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT
OFFICE); 〒103-0013 東京都中央区日本橋人形町1
丁目3番6号共同ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AF, AG, AI, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GI, GM, GR, GU, HT,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

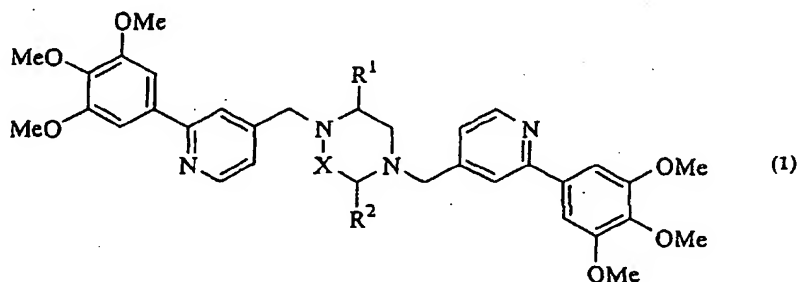
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PIPERAZINE COMPOUNDS

(54) 発明の名称: ピペラジン化合物



(57) Abstract: Piperazine compounds represented by the general formula (1), acid-addition salts thereof, or hydrates of both: (1) [wherein X is -CH₂-, -C(O)-, or -CH(CH₃)-; R¹ is hydrogen or alkyl; R² is hydrogen, alkyl, hydroxyalkyl, arylalkyl, heteroarylalkyl, carboxyalkyl, carbamoylalkyl, aminoalkyl, or guanidinoalkyl]. The compounds (1) exhibit excellent inhibitory activities against cell

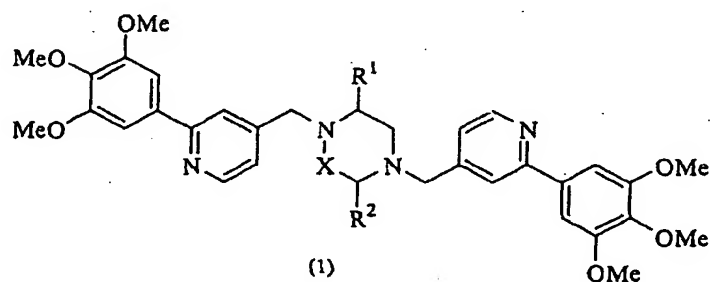
adhesion and cell infiltration and are useful in the prevention and treatment of allergy, asthma, rheumatic diseases, arteriosclerosis, inflammation, and so on.

[続葉有]



(57) 要約:

次の一般式 (1)



[式中、Xは $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ を示し；R¹は水素原子又はアルキル基を示し；R²は水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、カルボキシアルキル基、カルバモイルアルキル基、アミノアルキル基又はグアニジノアルキル基を示す]で表されるピペラジン化合物、その酸付加塩又はそれらの水和物。

本発明化合物(1)は優れた細胞接着及び細胞浸潤阻害作用を有し、アレルギー、喘息、リウマチ、動脈硬化症、炎症等の予防及び治療に有用である。